

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局



(43) 国際公開日  
2005 年 1 月 6 日 (06.01.2005)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2005/000790 A1

(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: C07C 229/50, 317/48, 323/61, 233/81, A61K 31/198, 31/216, 31/381, A61P 25/12, 25/14, 25/16, 25/24, 25/28, 25/30, 43/00, C07D 333/18

Atsuro) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/009384

(74) 代理人: 小林 浩, 外(KOBAYASHI, Hiroshi et al.); 〒1040028 東京都中央区八重洲二丁目 8 番 7 号 福岡ビル 9 階 阿部・井窪・片山法律事務所 Tokyo (JP).

(22) 国際出願日: 2004 年 6 月 25 日 (25.06.2004)

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2003-181931 2003 年 6 月 26 日 (26.06.2003) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 大正製薬株式会社 (TAISHO PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 Tokyo (JP).

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ユーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(72) 発明者; および

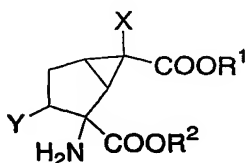
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 安原 明登 (YASUHARA, Akito) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 坂上 一成 (SAKAGAMI, Kazunari) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 太田 裕之 (OHTA, Hiroshi) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 中里 篤郎 (NAKAZATO,

添付公開書類:  
— 国際調査報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: 2-AMINOBIKICLO[3.1.0]HEXANE-2,6-DICARBOXYLIC ACID DERIVATIVE

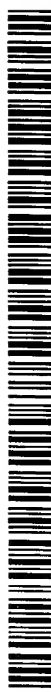
(54) 発明の名称: 2-アミノビシクロ[3.1.0]ヘキサン-2,6-ジカルボン酸誘導体



[ I ]

(57) Abstract: A drug which is effective in treatments for and prevention of psychiatric disorders and in treatments for and prevention of neurological diseases. The drug has an antagonistic effect on a Group II metabotropic glutamate receptor. It is a 2-aminobicyclo[3.1.0]hexane-2,6-dicarboxylic acid derivative represented by the formula [I]: [I] (wherein R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> are the same or different and each represents hydrogen, C<sub>1-10</sub> alkyl, etc.; X represents hydrogen or fluorine; and Y represents amino, -SR<sup>3</sup>, -S(O)<sub>n</sub>R<sup>7</sup>, -SCHR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>, -S(O)<sub>n</sub>CHR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>, -NHCHR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>, -N(CHR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>)(CHR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>), -NHCOR<sup>3</sup>, or -OCOR<sup>7</sup>), a pharmaceutically acceptable salt of the derivative, a hydrate of either, etc.

[続葉有]



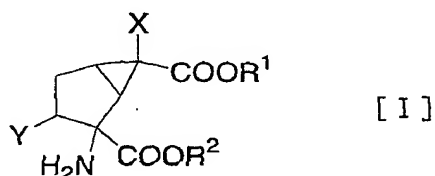
WO 2005/000790 A1



## (57) 要約:

本発明は、精神医学的障害の治療及び予防、並びに、神経学的疾患の治療効果及び予防効果を有する薬物であって、グループIIメタボトロピックグルタミン酸受容体に拮抗する薬物を提供することを目的とする。

上記の課題は、式 [ I ]



[式中、 $R^1$ 及び $R^2$ は、同一又は異なって、水素原子、 $C_{1-10}$ アルキル基、などを示し、 $X$ は、水素原子又はフッ素原子を示し、 $Y$ は、アミノ基、 $-SR^3$ 、 $-S(O)_nR^7$ 、 $-SCHR^3R^4$ 、 $-S(O)_nCHR^3R^4$ 、 $-NHCHR^3R^4$ 、 $-N(CHR^3R^4)(CHR^5R^6)$ 、 $-NHCOR^3$ 、又は $-OCOR^7$ を示す。]で表される2-アミノ-ビシクロ[3. 1. 0]ヘキサン-2, 6-ジカルボン酸誘導体、その医薬上許容される塩又はその水和物などにより解決される。